

(11)Publication number : 09-241239

(43)Date of publication of application : 16.09.1997

(51)Int.Cl.

C07D209/18
A01N 43/38

(21)Application number : 08-079580

(71)Applicant : AGENCY OF IND SCIENCE & TECHNOL

(22)Date of filing : 06.03.1996

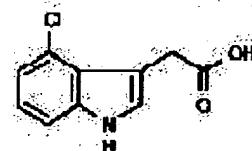
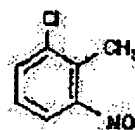
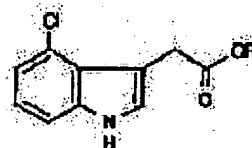
(72)Inventor : KATAYAMA MASATO

(54) ESTERS OF 4-CHLOROINDOLE-3-ACETIC ACID

(57)Abstract:

PROBLEM TO BE SOLVED: To obtain a new ester especially having a strong action on the stimulation of the rooting of a plant as a plant growth-regulating agent.

SOLUTION: This compound is expressed by formula I (R is an alkyl such as ethyl, 1-propyl, 2-propyl, 1-butyl, isobutyl, 2-butyl, (R)-2-butyl, (S)-2-butyl, tert-butyl, 1-pentyl or an aryl), e.g. 4-chloroindole-3-acetic acid ethyl ester. The compound of formula I is obtained by producing 4-chloroindole-3-acetic acid of formula III from 2-chloro-6-nitrotoluene of formula II as a starting substance through five processes and then reacting the compound of formula III with an alcohol in the presence of dimethylaminopyridine and N,N- dicyclohexylcarbodiimide in methylene chloride. The compound of formula I exhibits a strong auxin activity in a lower concentration than the conventional free 4-chloroindole-3-acetic acid.



LEGAL STATUS

[Date of request for examination] 06.03.1996

[Date of sending the examiner's decision of rejection] 30.06.1998

[Kind of final disposal of application other than the examiner's decision of rejection or application converted registration]

[Date of final disposal for application]

[Patent number] 3026155

[Date of registration] 28.01.2000

[Number of appeal against examiner's decision of rejection] 10-11229

[Date of requesting appeal against examiner's decision of rejection] 16.07.1998

[Date of extinction of right]

(19) 日本国特許庁 (J P)

(12) 公開特許公報 (A)

(11) 特許出願公開番号

特開平9-241239

(43) 公開日 平成9年(1997)9月16日

(51) Int.Cl.⁶

識別記号

庁内整理番号

F I

技術表示箇所

C 0 7 D 209/18

C 0 7 D 209/18

A 0 1 N 43/38

A 0 1 N 43/38

審査請求 有 請求項の数 2 F D (全 8 頁)

(21) 出願番号 特願平8-79580

(22) 出願日 平成8年(1996)3月6日

(71) 出願人 000001144

工業技術院長

東京都千代田区霞が関1丁目3番1号

(72) 発明者 片山 正人

愛知県名古屋市長区篠ノ風3丁目252番地

滝ノ水住宅10棟308号

(74) 指定代理人 工業技術院名古屋工業技術研究所長

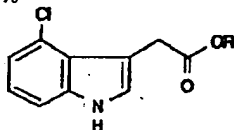
(54) 【発明の名称】 4-クロロインドール-3-酢酸のエステル類

(57) 【要約】 (修正有)

シン活性を有する。

【課題】 植物成長調節作用を有する新規4-クロロインドール-3-酢酸のエステル類を提供する。

【解決手段】 下記の式(1) (式中、Rはエチル、1-プロピル、2-プロピル、1-ブチル、イソブチル、2-ブチル、(R)-2-ブチル、(S)-2-ブチル、tert-ブチル、1-ペンチルのアルキル基およびアリル基を表す) で示される4-クロロインドール-3-酢酸のエステル類。上記の4-クロロインドール-3-酢酸のエステル類を有効成分とすることを特徴とする植物の根の発根を強く促進する作用を有する植物成長調節剤。



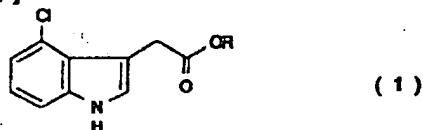
(1)

【効果】 式(1)で示される4-クロロインドール-3-酢酸のエステル類は、従来のフリーの酸である4-クロロインドール-3-酢酸よりも低濃度で強いオーキ

【特許請求の範囲】

【請求項1】 下記の式(1)

【化1】



(式中、Rはエチル、1-プロピル、2-プロピル、1-ブチル、イソブチル、2-ブチル、(R)-2-ブチル、(S)-2-ブチル、tert-ブチル、1-ペンチルのアルキル基およびアリル基を表す)で示される4-クロロインドール-3-酢酸のエステル類。

【請求項2】 請求項1記載の4-クロロインドール-3-酢酸のエステル類を有効成分とすることを特徴とする植物の根の発根を強く促進する作用を有する植物成長調節剤。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野】本発明は、植物成長調節作用を有する新規4-クロロインドール-3-酢酸のエステル類に関するものであり、更に詳しくは、本発明は、従来の植物成長調節剤と比べて、特に、植物の根の発根を強く促進する作用を有する新規化合物および該化合物を有効成分とする新しい植物成長調節剤に関するものである。

【0002】

【従来の技術】従来、植物成長調節作用を有する物質として、いわゆるオーキシン活性を有する種々の化合物が報告されており、例えば、インドール-3-酢酸(IAA)及びその誘導体(インドール-3-酢酸メチルエステル、インドール-3-アセトアミドなど)、4-(インドール-3-)酪酸、 α -ナフタレンアセトアミドなどが植物の成長を制御することは古くから知られている。また、従来、フリーの酸である4-クロロインドール-3-酢酸(4-Cl-IAA)は、天然オーキシン類の中で、特に極めて強いオーキシン活性を有することが報告されている(S. Marumo, H. Hattori and A. Yamamoto, In Plant Growth Substance, 1973, pp. 419-428. Hirokawa Publishing Company Inc., Tokyo)。

【0003】

【発明が解決しようとする課題】ところで、世界の人口の増加に伴い、食料として利用される作物の増収を図ること、或いは地球上の森林の減少を伴う地球温暖化を防止することは極めて重要な課題となってきた。これらの作物の増収や地球温暖化の防止のための森林の回復の要件の一つとして、作物の発根を顕著に促進させる作

用を有する優れた植物成長調節剤の開発が必要であることが挙げられる。しかしながら、IAAなどのいわゆるオーキシン活性を有する従来の植物成長調節剤では植物の根の発根を促すための作用は十分とは言えない。また、環境に優しい化合物であることも近年の環境問題から重要なファクターの一つとなって来ている。そのため環境に優しく、植物の根の発根を微量で強く促進する作用を有する物質が強く望まれている。

【0004】このような状況の中で、本発明者は、微量で植物の根の発根を強く促進する作用を有する新しい植物成長調節剤を開発することを目標として鋭意研究を積み重ねた結果、特定の4-クロロインドール-3-酢酸のエステル類が低濃度で極めて強い発根促進作用などを有することを見出し、本発明を完成するに至った。

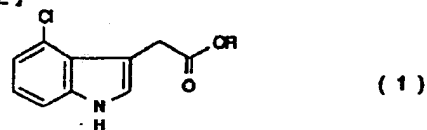
【0005】本発明は、植物の根の発根を強く促進する作用を有する新規化合物を提供することを目的とする。また、本発明は、上記化合物を有効成分とすることを特徴とする植物の根の発根を強く促進する作用を有する植物成長調節剤を提供することを目的とする。

【0006】

【課題を解決するための手段】上記課題を解決するための本発明は、下記の式(1)

【0007】

【化2】



【0008】(式中、Rはエチル、1-プロピル、2-プロピル、1-ブチル、イソブチル、2-ブチル、(R)-2-ブチル、(S)-2-ブチル、tert-ブチル、1-ペンチルのアルキル基およびアリル基を表す)で示される4-クロロインドール-3-酢酸のエステル類、である。また、本発明の他の態様は、上記の4-クロロインドール-3-酢酸のエステル類を有効成分とすることを特徴とする植物の根の発根を強く促進する作用を有する植物成長調節剤、である。

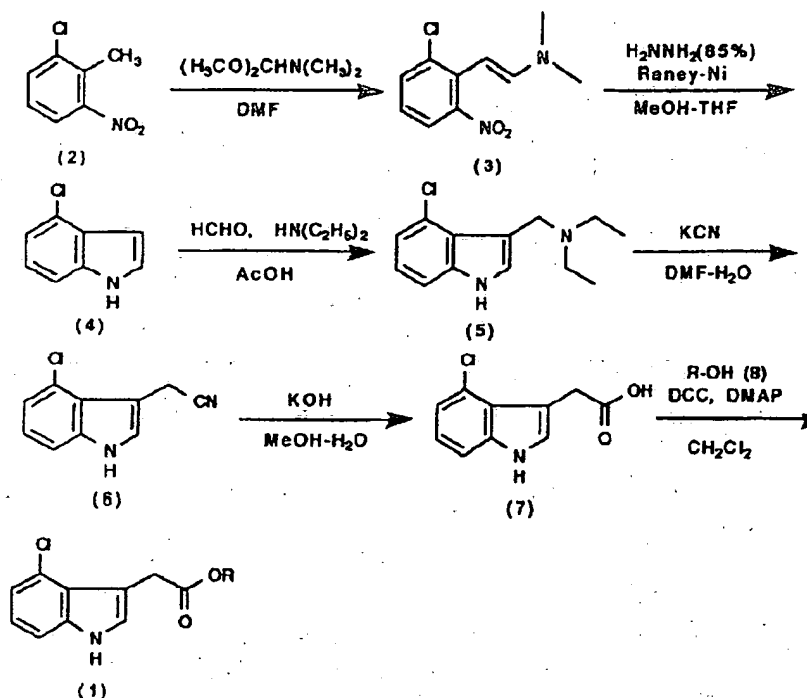
【0009】

【発明の実施の形態】以下、本発明を詳細に説明する。

【0010】上記の式(1)の4-クロロインドール-3-酢酸のエステル類(以下、式(1)の化合物という)は、例えば、次の反応によって製造することができる。

【0011】

【化3】



【0012】上記反応工程において、式(8)で表されるR-OHは、式中、Rはエチル、1-プロピル、2-プロピル、1-ブチル、イソブチル、2-ブチル、

(R)-2-ブチル、(S)-2-ブチル、tert-ブチル、1-ペンチルのアルキル基およびアリル基を示すアルコール類である。即ち、2-クロロ-6-ニトロトルエン(式(2))をジメチルホルムアミド中ジメチルホルムアミドジメチルアセタールと加熱して得られる式(3)で示される化合物を還元剤、好ましくはラネーニッケル-ヒドラジンを用いて還元・環化を行うと式

(4)で示す化合物4-クロロインドールが得られる。次に、ホルムアルデヒドをジエチルアミンの酢酸溶液に加えた溶液を式(4)で示される4-クロロインドールに加え、室温で反応すると式(5)で示されるアミン化合物を得ることができ、更に、このアミン化合物(5)をジメチルホルムアミド-水中でシアン化カリウムとの反応によって式(6)で示される4-クロロインドール-3-アセトニトリルを得ることができる。

【0013】続いて、ニトリル(6)を低級アルコール(例えばメタノール)に溶解したのち、アルカリ、好ましくは水酸化アルカリ(例えば水酸化カリウム)水溶液を加え加熱還流することにより式(7)で示される4-クロロインドール-3-酢酸を得ることができる。更に、式(7)で示される酢酸化合物を塩化メチレン中でジメチルアミノピリジンの存在下、式(8)で示されるアルコールをN,N-ジシクロヘキシルカルボジミドと反応することにより式(1)で示される4-クロロインドール-3-酢酸のエステル類を得ることができる。

【0014】式(1)の化合物は、後記の製造例に示し

た物性を有する新規化合物である。また、式(1)の化合物は、後記の試験例に具体的に示したように、従来、特に極めてオーキシシン活性が強いと報告されているフリーの酸(4-Cl-IAA)よりも低濃度で強いオーキシシン活性を有することが分かった。

【0015】式(1)で示される化合物を植物成長調節剤の有効成分として使用する場合、使用目的に応じて、そのまま使用するか、又はその作用効果を助長若しくは安定化するために農業で通常用いられるドデシルベンゼンスルホン酸ナトリウム、ノニルフェニルエーテル、タルクなどの補助剤と混合して、液剤、粉剤、粒剤、水和剤、カプセル剤、フロアブル剤又は乳剤のような製剤形態にして使用することもできる。また、他の農業、肥料、植物成長調節剤などと適宜混合して使用することも可能である。

【0016】これらの製剤は実際の使用においては直接そのまま使用するか、又は水で所定の濃度に希釈して使用することもできる。式(1)で示される化合物は通常 $1 \times 10^{-7} \sim 1 \times 10^{-2} \text{M}$ の濃度の範囲で使用することができるが、この範囲に限定されるものではない。本発明の植物成長調節剤は、上記式(1)の化合物を有効成分とすることを特徴とするものであり、薬剤としての他の構成は、製剤方法、製剤形態、使用方法などを含めて、特に限定するものではない。

【0017】

【実施例】以下、実施例により本発明を具体的に説明するが、本発明は該実施例により何ら限定されるものではない。

【0018】製造例1

4-クロロインドール-3-酢酸エチルエステル (1a) の製造

4-クロロインドール-3-酢酸 (10.0 g, 47.7 mmol) の塩化メチレン (150 ml) 溶液にエタノール (6.6 g, 143.1 mmol)、N, N-ジシクロヘキシルカルボジイミド (14.7 g, 71.5 mmol) とジメチルアミノピリジン (0.6 g, 5.0 mmol) を加え、室温で4時間攪拌した。生じた沈殿を濾過で除去したのち、濾液を減圧濃縮し、得られた粗エステルを塩化メチレンを溶出溶媒としてシリカゲルカラムクロマトグラフィーを行って精製し、更に、酢酸エチル-n-ヘキサンから再結晶化して4-クロロインドール-3-酢酸エチルエステル (1a) (8.4 g, 74.4%収率) を得た。

【0019】上記製造例で得た化合物の物性を以下に示す。

mp: 79-80°C

IR spectrum (ν_{\max} KBr (cm^{-1})): 3325, 2975, 1735, 1620, 1570, 1555, 1485, 1435, 1405, 1370, 1340, 1250, 1210, 1185, 1140, 1110, 1080, 1045, 1015, 935, 875, 815, 760, 735, 680, 595

MS spectrum (70 eV): m/z 237 (M^+), 239 (M^+)

$^1\text{H-NMR}$ spectrum (90 MHz, ppm) (acetone- d_6 , TMS): 1.22 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 3.98 (2H, s), 4.12 (2H, q, $J=7.0$ Hz), 6.8-7.5 (4H, m), 10.37 (1H, broad s)

【0020】製造例2

4-クロロインドール-3-酢酸1-プロピルエステル (1b) の製造

4-クロロインドール-3-酢酸 (10.0 g, 47.7 mmol) の塩化メチレン (150 ml) 溶液に1-プロパノール (8.6 g, 143.1 mmol)、N, N-ジシクロヘキシルカルボジイミド (14.7 g, 71.5 mmol) とジメチルアミノピリジン (0.6 g, 5.0 mmol) を加え、室温で3時間攪拌した。生じた沈殿を濾過で除去したのち、濾液を減圧濃縮し、得られた粗エステルを塩化メチレンを溶出溶媒としてシリカゲルカラムクロマトグラフィーを行って精製し、更に、酢酸エチル-n-ヘキサンから再結晶化して4-クロロインドール-3-酢酸1-プロピルエステル (1b) (8.7 g, 72.5%収率) を得た。

【0021】上記製造例で得た化合物の物性を以下に示す。

mp: 83-84°C

IR spectrum (ν_{\max} KBr (cm^{-1})): 3290, 2980, 2970, 2925, 1730, 1620, 1

570, 1490, 1440, 1410, 1395, 1340, 1255, 1220, 1195, 1175, 1155, 1145, 1080, 1055, 1045, 965, 940, 920, 820, 780, 760, 740

MS spectrum (70 eV): m/z 251 (M^+), 253 (M^+)

$^1\text{H-NMR}$ spectrum (90 MHz, ppm) (acetone- d_6 , TMS): 0.89 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.62 (3H, tq, $J=6.6, 7.0$ Hz), 3.99 (2H, s), 4.04 (2H, t, $J=6.6$ Hz), 6.8-7.5 (4H, m), 10.38 (1H, broad s)

【0022】製造例3

4-クロロインドール-3-酢酸アリルエステル (1c) の製造

4-クロロインドール-3-酢酸 (10.0 g, 47.7 mmol) の塩化メチレン (150 ml) 溶液に2-プロパノール (8.3 g, 143.1 mmol)、N, N-ジシクロヘキシルカルボジイミド (14.7 g, 71.5 mmol) とジメチルアミノピリジン (0.6 g, 5.0 mmol) を加え、室温で3時間攪拌した。生じた沈殿を濾過で除去したのち、濾液を減圧濃縮し、得られた粗エステルを塩化メチレンを溶出溶媒としてシリカゲルカラムクロマトグラフィーを行って精製し、更に、酢酸エチル-n-ヘキサンから再結晶化して4-クロロインドール-3-酢酸アリルエステル (1c) (10.1 g, 84.9%収率) を得た。

【0023】上記製造例で得た化合物の物性を以下に示す。

mp: 84-85°C

IR spectrum (ν_{\max} KBr (cm^{-1})): 3320, 1730, 1620, 1565, 1550, 1495, 1435, 1405, 1370, 1335, 1250, 1185, 1140, 1110, 1045, 975, 935, 910, 815, 765, 735, 690, 590

MS spectrum (70 eV): m/z 249 (M^+), 251 (M^+)

$^1\text{H-NMR}$ spectrum (90 MHz, ppm) (acetone- d_6 , TMS): 4.03 (2H, s), 4.60 (2H, ddd, $J=5.5, 1.5, 1.5$ Hz), 5.15 (1H, ddt, $J=10.1, 1.5, 1.5$ Hz), 5.26 (1H, ddt, $J=17.1, 1.5, 1.5$ Hz), 5.95 (1H, ddt, $J=17.1, 10.1, 5.5$ Hz), 6.8-7.5 (4H, m), 10.37 (1H, broad s)

【0024】上記製造例 (1) と同様に反応を行って得た4-クロロインドール-3-酢酸2-プロピルエステル (1d) の物性を以下に示す。

mp: 100-101°C

IR spectrum (ν_{\max} KBr (cm^{-1})) : 3300, 2980, 1715, 1615, 1565, 1485, 1430, 1365, 1340, 1325, 1250, 1200, 1170, 1140, 1100, 955, 930, 810, 760, 730, 600

MS spectrum (70 eV) : m/z 251 (M^+), 253 (M^+)

$^1\text{H-NMR}$ spectrum (90 MHz, ppm) (acetone- d_6 , TMS) : 1.22 (6H, d, $J=6.3\text{ Hz}$), 3.94 (2H, s), 4.99 (1H, septet, $J=6.3\text{ Hz}$), 6.8-7.5 (4H, m), 10.35 (1H, broad s)

【0025】上記製造例(1)と同様に反応を行って得た4-クロロインドール-3-酢酸1-ブチルエステル(1e)の物性を以下に示す。

mp : 75-76°C

IR spectrum (ν_{\max} KBr (cm^{-1})) : 3310, 2940, 2850, 1720, 1615, 1565, 1545, 1480, 1465, 1430, 1390, 1355, 1335, 1180, 1105, 1080, 1020, 970, 930, 805, 750, 730, 675, 585

MS spectrum (70 eV) : m/z 265 (M^+), 267 (M^+)

$^1\text{H-NMR}$ spectrum (90 MHz, ppm) (acetone- d_6 , TMS) : 0.89 (3H, t, $J=6.4\text{ Hz}$), 1.2-1.8 (4H, m), 3.98 (2H, s), 4.09 (2H, t, $J=6.4\text{ Hz}$), 6.8-7.5 (4H, m), 10.35 (1H, broad s)

【0026】上記製造例(1)と同様に反応を行って得た4-クロロインドール-3-酢酸イソブチルエステル(1f)の物性を以下に示す。

mp : 109-110°C

IR spectrum (ν_{\max} KBr (cm^{-1})) : 3300, 2960, 1720, 1620, 1570, 1485, 1470, 1430, 1375, 1355, 1340, 1250, 1205, 1170, 1140, 1045, 1000, 935, 810, 765, 740, 590

MS spectrum (70 eV) : m/z 265 (M^+), 267 (M^+)

$^1\text{H-NMR}$ spectrum (90 MHz, ppm) (acetone- d_6 , TMS) : 0.88 (6H, d, $J=6.6\text{ Hz}$), 1.91 (1H, tof septet, $J=6.6, 6.6\text{ Hz}$), 3.87 (2H, d, $J=6.6\text{ Hz}$), 4.00 (2H, s), 6.8-7.5 (4H, m), 10.34 (1H, broad s)

【0027】上記製造例(1)と同様に反応を行って得た4-クロロインドール-3-酢酸2-ブチルエステル(1g)の物性を以下に示す。

mp : 114-115°C

IR spectrum (ν_{\max} KBr (cm^{-1})) : 3280, 2970, 2920, 1725, 1620, 1570, 1490, 1435, 1405, 1375, 1335, 1255, 1215, 1195, 1110, 1080, 1045, 995, 945, 885, 815, 775, 750, 735

MS spectrum (70 eV) : m/z 265 (M^+), 267 (M^+)

$^1\text{H-NMR}$ spectrum (90 MHz, ppm) (acetone- d_6 , TMS) : 0.86 (3H, t, $J=7.0\text{ Hz}$), 1.19 (3H, d, $J=6.2\text{ Hz}$), 1.56 (2H, dq, $J=6.2, 7.0\text{ Hz}$), 4.83 (1H, tq, $J=6.2, 6.2\text{ Hz}$), 6.8-7.5 (4H, m), 10.35 (1H, broad s)

【0028】上記製造例(1)と同様に反応を行って得た4-クロロインドール-3-酢酸(R)-2-ブチルエステル(1h)の物性を以下に示す。

mp : 135-136°C

IR spectrum (ν_{\max} KBr (cm^{-1})) : 3280, 2970, 2920, 1725, 1620, 1570, 1490, 1435, 1405, 1375, 1335, 1255, 1215, 1195, 1110, 1080, 1045, 995, 945, 885, 815, 775, 750, 735

MS spectrum (70 eV) : m/z 265 (M^+), 267 (M^+)

$^1\text{H-NMR}$ spectrum (90 MHz, ppm) (acetone- d_6 , TMS) : 0.86 (3H, t, $J=7.0\text{ Hz}$), 1.19 (3H, d, $J=6.2\text{ Hz}$), 1.56 (2H, dq, $J=6.2, 7.0\text{ Hz}$), 4.83 (1H, tq, $J=6.2, 6.2\text{ Hz}$), 6.8-7.5 (4H, m), 10.35 (1H, broad s)

【0029】上記製造例(1)と同様に反応を行って得た4-クロロインドール-3-酢酸(S)-2-ブチルエステル(1i)の物性を以下に示す。

mp : 134-135°C

IR spectrum (ν_{\max} KBr (cm^{-1})) : 3280, 2970, 2920, 1725, 1620, 1570, 1490, 1435, 1405, 1375, 1335, 1255, 1215, 1195, 1110, 1080, 1045, 995, 945, 885, 815, 775, 750, 735

MS spectrum (70 eV) : m/z 265 (M^+), 267 (M^+)

$^1\text{H-NMR}$ spectrum (90 MHz, ppm) (acetone- d_6 , TMS) : 0.86 (3H, t, $J=7.0\text{ Hz}$), 1.19 (3H, d, $J=6.2\text{ Hz}$), 1.56 (2H, dq, $J=6.2, 7.0\text{ Hz}$), 4.83 (1H, tq, $J=6.2, 6.2\text{ Hz}$), 6.8-7.5 (4H, m), 10.35 (1H, broad s)

【0030】上記製造例(1)と同様に反応を行って得た4-クロロインドール-3-酢酸tert-ブチルエステル(1j)の物性を以下に示す。

mp: 142-143°C

IR spectrum (ν_{\max} KBr (cm^{-1})): 3335, 3000, 2985, 1725, 1620, 1560, 1490, 1440, 1410, 1370, 1360, 1340, 1300, 1260, 1220, 1160, 1120, 1080, 1050, 950, 935, 865, 820, 755, 735, 600, 570

MS spectrum (70 eV): m/z 265 (M^+), 267 (M^+)

$^1\text{H-NMR}$ spectrum (90 MHz, ppm) (acetone- d_6 , TMS): 1.44 (9H, s), 3.89 (2H, s), 6.8-7.5 (4H, m), 10.35 (1H, broad s)

【0031】上記製造例(1)と同様に反応を行って得た4-クロロインドール-3-酢酸1-ペンチルエステル(1k)の物性を以下に示す。

mp: 70-71°C

IR spectrum (ν_{\max} KBr (cm^{-1})): 3330, 2950, 2925, 1715, 1620, 1570, 1490, 1435, 1410, 1390, 1355, 1300, 1255, 1200, 1180, 1045, 975, 935, 835, 815, 760, 735, 590, 570

MS spectrum (70 eV): m/z 279 (M^+), 281 (M^+)

$^1\text{H-NMR}$ spectrum (90 MHz, ppm) (acetone- d_6 , TMS): 0.85 (3H, t, $J=5.9\text{ Hz}$), 1.0-1.6 (4H, m), 1.61 (2H, quintet, $J=6.2\text{ Hz}$), 3.98 (2H, s), 4.08 (2H, t, $J=6.2\text{ Hz}$), 6.8-7.5 (4H, m), 10.37 (1H, broad s)

【0032】試験例1

ハクチョウゲを用いた発根試験

本年枝の暗紫色部の下から3節の上部を切除した後、その3節の葉を半分切除し、更にその下の8-10節を残して水平切りする。下部の8-10節の葉は全て除去する。このように調製したハクチョウゲのさし穂を茎部から4 cmほど試験サンプルのエタノール溶液に10秒間浸漬した後風乾する。風乾したさし穂を赤玉土のさし床に案内棒であけた穴に植え付け、土を良く押さえつけて日中23°C、夜間15°Cのグリーンハウスで68日間生育させて後、発生した発根数をカウントした。対照区はさし穂をエタノールのみに10秒間浸漬させた後、試験サンプルと同様に処理した。尚、試験サンプルとしては、上記製造例で得た化合物1a~1k(1jを除く)を用い、 $1 \times 10^{-4}\text{ M}$ の濃度のエタノール溶液を使用した。また、比較例として、IAA、4-(インドール-3-) 酢酸(4-IBA)および4CI-IAAの $1 \times 10^{-4}\text{ M}$ の濃度のエタノール溶液を用いた。その結果を表1に示す。

【0033】

【表1】

ハクチョウゲに対する効果

Sample	Number of Roots / Plant
Control	7.0
IAA	13.1
4-IBA	23.1
4-CHIAA	70.4
4-CHIAA Et	78.6
4-CHIAA AByl	72.5
4-Cl-IAA 1-Pr	61.7
4-Cl-IAA 2-Pr	48.8
4-CHIAA 1-Bu	52.8
4-CHIAA IsoBu	60.7
4-CHIAA 2-Bu	45.7
4-Cl-IAA (R)-2-Bu	42.1
4-Cl-IAA (S)-2-Bu	38.0
4-CHIAA Pentyl	55.2

【0034】上記の表1の結果から明らかなように、本発明の化合物は、オーキシン活性の一つである発根作用試験において、ハクチョウゲのさし穂に対して極めて強い発根作用を有することが確認された。この結果は本発明の化合物が、従来発根剤として市販されている4-(インドール-3-) 酢酸(4-IBA)の2~3倍以

上の極めて強い発根作用を有することを示すものである。また、エチル及びアリルエステルはフリーの酸である4-Cl-IAAを上回る強い発根活性を示した。

【0035】試験例2

白菜を用いた生物試験

白菜(品種: 錦秋)種子を水道水でよく洗ったのち、蒸

留水で濯ぎ、シャーレ中の蒸留水を充分湿らせた脱脂綿上に播き、25℃で約24時間インキュベートした。少し根が出た状態の種子10個を直径6cmのシャーレに試験サンプルの5ml水溶液を染み込ませた濾紙(φ5.5cm)上に置床し、暗黒下3日間インキュベートした後、下胚軸の長さを測定した。尚、試験サンプルと白菜に対する効果

しては、上記製造例で得た化合物1a~1k(1jを除く)の所定濃度のサンプルを用いた。また、比較例として、IAA、4-CI-IAAの所定濃度のサンプルを用いた。その結果を表2に示す。

【0036】

【表2】

Compounds	3 × 10 ⁻⁷	Concentration (M)		
		1 × 10 ⁻⁶	3 × 10 ⁻⁶	1 × 10 ⁻⁵
4-CHIAA Et	21.3 mm	12.0 mm	7.7 mm	5.7 mm
4-CHIAA Allyl	20.4	11.5	7.1	4.5
4-CHIAA 1-Pr	18.6	11.9	8.2	5.9
4-CHIAA 2-Pr	21.5	16.8	11.3	8.9
4-CHIAA 1-Bu	17.8	12.5	8.9	5.2
4-CHIAA IsoBu	17.1	14.5	9.7	6.1
4-CHIAA 2-Bu	21.8	15.5	11.0	7.4
4-CHIAA (R)-2-Bu	18.6	16.6	10.2	7.1
4-CHIAA (S)-2-Bu	21.5	19.6	18.0	12.5
4-CHIAA Pentyl	19.8	18.6	11.2	6.5
IAA	24.6	25.3	25.1	24.0
4-CHIAA	22.2	18.2	13.7	8.0
Control	24.4			

【0037】上記表2の結果から明らかなように、本発明の化合物のうち、特に1a、1b、1cは、オーキシン活性の一つである白菜の下胚軸の成長抑制作用において極めて強い抑制作用を有することが確認された。この結果は、本発明の化合物が、従来、特に極めてオーキシン活性が強いと報告されているフリーの酸の4-CI-IAAよりも低濃度で強いオーキシン活性を有することを示すものである。

【0038】試験例3

マングビーン芽生えを用いた生物試験

初生葉が展開した日に、マングビーン芽生えを100mlの三角フラスコに液肥を入れて、7本ずつ水耕栽培

し、水耕液は、ハイポネックス(ハイポネックスコーポレーション社製)500倍溶液を三角フラスコに100mlずつ入れた。試験サンプルとして、上記製造例で得た化合物1a~1k(1jを除く)の所定濃度のサンプル液を散布し、また、比較例として、4-CI-IAA液を散布し、日中25℃、夜間20℃のビニールハウスに置いて生育させた。処理4日後に初生葉の生育がほぼ終了した時点で、蒸散量、芽生えの新鮮重量を測定した。その結果を表3に示す。

【0039】

【表3】

マングビーン芽生えに対する効果

Compounds	Transpiration volume (% of Control)		Fresh weight (% of Control)	
	Concentration (ppm)		Concentration (μg)	
	100	1	100	1
4-CHAA Et	28.1	88.3	72.1	122
4-CHAA 1-Pr	30.6	71.9	78.4	118
4-CHAA Allyl	31.8	71.4	88.6	112
4-CHAA 2-Pr	40.8	80.7	84.2	114
4-CHAA 1-Bu	37.2	73.0	92.7	111
4-CHAA IsoBu	35.7	86.6	88.4	105
4-CHAA 2-Bu	33.2	82.1	82.4	107
4-CHAA (R)-2-Bu	35.0	81.6	81.8	107
4-CHAA (S)-2-Bu	32.1	83.7	76.7	110
4-CHAA Pentyl	39.0	81.1	89.8	105
4-CHAA	41.8	84.0	95.5	104
Control	100.0		100.0	

【0040】上記表3の結果から明らかなとおり、本発明の化合物は、フリーの酸を顕著に上回る蒸散抑制作用と高濃度（100 ppm）での新鮮重量の減少、低濃度（1 ppm）での増加作用を有することが確認された。この結果は、本発明の化合物が、従来、特に極めてオーキシシン活性が強いと報告されているフリーの酸の4-CHAAよりも低濃度で強いオーキシシン活性を有することを示すものである。

【0041】実施例1

（液剤の製造）以下の原料成分を用いて、常法により製剤することにより液剤形態の植物成長調節剤を製造した。4-クロロインドール-3-酢酸エチルエステル23.7gを補助溶剤、エタノール1リットルに溶解した。使用に際しては本溶液を1000倍希釈して用いる。希釈液は 1×10^{-4} Mの濃度溶液であるが、 $1 \times 10^{-7} \sim 1 \times 10^{-2}$ Mの濃度範囲で使用可能であり、この濃度に限定されるものではない。

【0042】実施例2

（粉剤の製造）以下の原料成分を用いて、常法により製剤することにより粉剤形態の植物成長調節剤を製造した。4-クロロインドール-3-酢酸アリルエステル1gをアセトン1リットルに溶解し、補助剤タルク499gを加えた後、アセトンを完全に除去、乾燥して4-クロロインドール-3-酢酸アリルエステルの0.2%タルク粉剤を得た。これは0.2%濃度の粉剤であるが、0.001~1%の濃度範囲で使用可能であり、この濃度に限定されるものではない。

【0043】実施例3

（乳剤の製造）以下の原料成分を用いて、常法により製剤することにより乳剤形態の植物成長調節剤を製造した。4-クロロインドール-3-酢酸プロピルエステル23.7gを補助剤ドデシルベンゼンスルホン酸ナトリ

ウムとノニルフェニルエーテルを加えたキシレン1リットルに溶解する。使用に際しては、この溶液を1000倍希釈して用いるが、希釈液は 1×10^{-4} Mの濃度溶液であるが、 $1 \times 10^{-7} \sim 1 \times 10^{-2}$ Mの濃度範囲で使用可能であり、この濃度に限定されるものではない。

【0044】

【発明の効果】以上詳述した通り、本発明は、前記式

（1）（式中、Rはエチル、1-プロピル、2-プロピル、1-ブチル、イソブチル、2-ブチル、（R）-2-ブチル、（S）-2-ブチル、tert-ブチル、1-ペンチルのアルキル基およびアリル基を表す）で示される4-クロロインドール-3-酢酸のエステル類、上記の4-クロロインドール-3-酢酸のエステル類を有効成分とすることを特徴とする植物の根の発根を強く促進する作用を有する植物成長調節剤、に係わるものであり、本発明によれば次のような効果が得られる。

（1）植物成長調節作用を有する新規4-クロロインドール-3-酢酸エステル類を提供する。

（2）植物の根の発根を強く促進する作用を有する化合物を提供する。

（3）低濃度で強いオーキシシン活性を示す植物成長調節剤が得られる。

（4）本発明の化合物は、強力な発根作用を有する。例えば、ハクチョウゲの発根を極めて強力に促進する。

（5）本発明の化合物は、オーキシシン活性の一つである白菜の下胚軸由来の成長抑制作用において極めて強い抑制作用を有する。

（6）本発明の化合物は、マングビーンの芽生えに対してフリーの酸（4-CHAA）を顕著に上回る蒸散作用と高濃度（100 ppm）での新鮮重量の減少、低濃度（1 ppm）での増加作用を有する。